

(19)



JAPANESE PATENT OFFICE

PATENT ABSTRACTS OF JAPAN

(11) Publication number: **05097663 A**

(43) Date of publication of application: **20.04.93**

(51) Int. Cl.

A61K 9/72
A61K 9/00

(21) Application number: **03292316**

(22) Date of filing: **12.10.91**

(71) Applicant: **KANEBO LTD**

(72) Inventor: **TANAKA MASAYA**
OOI TOSHIYA
TAKAHASHI YOSHITERU
MIZUKAMI YOSHIKATSU

**(54) ASPIRATION TYPE PREPARATION FOR
COMMON COLD**

(57) Abstract

PURPOSE: To obtain an aspiration type preparation for common cold, containing a volatile medicine in a piece-like support consisting of a porous fiber, capable of safely using without causing dermatopathy.

CONSTITUTION: A volatile medicine of camphor, menthol, eucalyptus oil, etc., is absorbed and retained in a piece-like support consisting of a porous fiber by dropping, coating, spraying, etc., and as necessary, the support is dried to provide the objective product. The

support is used by properly cutting cloth such as knitted fabric, woven fabric or nonwoven fabric consisting of a porous acrylic fiber to a piece having 5-600cm² area. Symptoms of common cold such as difficulty in breathing, nasal congestion, rhinorrhea, sneezing, cough, expectoration and pain of throat can be relaxed using the preparation. The preparation can be used, especially in sleeping in a state fixed on chest, etc., without directly touching to skin by putting in a pocket of nightclothes or applying on the outer face of under garment with both face tape.

COPYRIGHT: (C)1993,JPO&Japio

(19) 日本国特許庁 (J P)

(12) 公開特許公報 (A)

(11) 特許出願公開番号

特開平5-97663

(43) 公開日 平成5年(1993)4月20日

(51) Int.Cl. ⁵	識別記号	庁内整理番号	F I	技術表示箇所
A 6 1 K 9/72		7329-4C		
9/00	W	7329-4C		

審査請求 未請求 請求項の数 2 (全 5 頁)

(21) 出願番号	特願平3-292316	(71) 出願人	000000952 鐘紡株式会社 東京都墨田区墨田五丁目17番4号
(22) 出願日	平成3年(1991)10月12日	(72) 発明者	田中 雅也 兵庫県神戸市須磨区桜木町2丁目2番12-109号
		(72) 発明者	大居 稔弥 大阪府堺市西野540番地小田第二マンション
		(72) 発明者	高橋 嘉輝 大阪府枚方市尊延寺5丁目32番2
		(72) 発明者	水上 義勝 大阪府大阪市都島区友浜町1丁目6番1-408号

(54) 【発明の名称】 感冒用吸入型製剤

(57) 【要約】

【構成】 気化性薬物を、多孔性アクリル繊維の如き多孔性繊維よりなる片状支持体に含有させたことを特徴とする感冒用吸入型製剤

【効果】 本発明の感冒用吸入型製剤は、効果が持続するとともに、従来の吸入型製剤と違って直接皮膚に貼付して使用する必要がないので皮膚障害を起こすことがなく、安全に使用することができる。

【特許請求の範囲】

【請求項1】 気化性薬物を、多孔性繊維よりなる片状支持体に含有させたことを特徴とする感冒用吸入型製剤。

【請求項2】 気化性薬物を、多孔性アクリル繊維よりなる片状支持体に含有させたことを特徴とする感冒用吸入型製剤。

【発明の詳細な説明】

【0001】

【産業上の利用分野】 本発明は、感冒用吸入型製剤に関する。更に詳しくは、気化性薬物を、多孔性繊維よりなる片状支持体に含有させたことを特徴とする感冒用吸入型製剤に関する。

【0002】

【従来の技術】 感冒は、「かぜ」、「かぜ症候群」、「感冒症候群」ともいわれ、日常、最も多く見られる疾患である。感冒は、息苦しさ、鼻づまり、鼻汁、くしゃみ、咳、痰、喉の痛み等の症状を伴うことが多く、このためにこれらの症状を緩和させるカンフル、メントール等の気化性薬物を鼻腔および口腔を通じて吸入させる所謂「ぬるかぜ薬」あるいは「貼るかぜ薬」と称する外用剤が、総合感冒剤等の経口製剤の他に用いられている。

【0003】 これらのタイプの外用剤は、胸や喉等に塗布あるいは貼付して用いられるため、直接皮膚に薬物や基剤が接触し、これらによるかぶれ、かゆみ、発赤等の皮膚障害が、特に、幼児や老人では生じ易い。また、「ぬるかぜ薬」では、使用感において、ベトベトした不快感があったり、衣服等に汚れを生じることがある等の欠点があり、「貼るかぜ薬」では、使用中に剥がれ落ちて薬効が得られなかったり、衣服等に汚れを生じることがある等の欠点がある。

【0004】

【発明が解決しようとする課題】 本発明者等は、かかる欠点を有さない新しいタイプの感冒用吸入型製剤の開発を目的として種々検討した。

【0005】

【課題を解決するための手段】 本発明者らは、種々検討した結果、感冒に伴う前記症状を緩和させることが知られているカンフル、メントール等の気化性薬物を、多孔性繊維よりなる片状支持体に吸着、保持させることによって得られる感冒用吸入型製剤が上記の目的に適うものであることを見出して、本発明を完成させた。以下、本発明を詳細に説明する。

【0006】 本発明製剤に用いる気化性薬物としては、感冒の前記症状に有効で、且つ、常温または室温で固体状態で昇華する特性を持つもの、あるいは液体状態で体温付近の温度で蒸発する特性を持つものであれば特に限定されない。これらの薬物としては、例えば、カンフル、メントール、チモール、ハッカ油、ユーカリ油、チョージ油、トウヒ油、ニクズク油、チンピ油等が挙げら

れる。また、これらのなかでカンフル、メントールのように天然型もしくは非天然型の存在するものは、その何れであっても良い。

【0007】 本発明製剤は、上記気化性薬物の支持体として、多孔性繊維よりなる編地、織地あるいは不織布等の布地を、通常5～600cm²の片状に適宜裁断して用いる。

【0008】 上記多孔性繊維としては、通常の方法によって多孔質化し、吸水性を付与した合成繊維であれば特に限定されないが、なかでも多孔性アクリル繊維が好適に使用される。また、上記多孔性繊維を、通常の方法によって編地、織地あるいは不織布等の布地にして使用する。

【0009】 多孔性アクリル繊維としては、例えば、アクワロン[®]（鐘紡社製）が、また、その布地としては、例えば、アクワロン[®] スムース（品番：9160、鐘紡社製）、アクワロン[®] ビエラP.T.（品番：9074、鐘紡社製）、アクワロン[®] パイル（品番：TN115、鐘紡社製）が特に好適に使用される。

【0010】 本発明製剤は、気化性薬物がメントールのように固体の場合には、エタノール等の適当な溶媒に溶解するか、ユーカリ油のような液状の気化性薬物を同時に使用する場合には、それらに溶解して、以下に示すような方法によって、多孔性繊維よりなる片状支持体に吸着、保持させて製造される。また、気化性薬物が液状の場合には、そのまま、もしくはエタノール等の適当な溶媒で希釈した後、上記と同様に多孔性繊維よりなる片状支持体に吸着、保持させて製造される。気化性薬物の使用量は、薬物の種類および/または組合せ、支持体の大きさ等により適宜決定される。

【0011】 気化性薬物を、多孔性繊維よりなる片状支持体に吸着、保持させるためには、気化性薬物あるいは気化性薬物を含有する溶液を、片状支持体に、例えば、滴下する、ローラー等により塗布する、もしくは噴霧する等の方法によって吸着させた後、必要に応じて乾燥するか、または、片状支持体を、気化性薬物あるいは気化性薬物を含有する溶液中に浸漬後、必要に応じて乾燥することによって行うことができる。

【0012】 上記のようにして得られる本発明製剤は、上記気化性薬物を透過させないラミネートフィルム等により被覆もしくは包装することによって容易に保存することができる。

【0013】 本発明製剤は、特に、就寝時における感冒の前記症状を緩和させる目的で好適に使用される。上記目的のためには、就寝時に本発明製剤をそのままパジャマ等の寝間着のポケットに入れるか、あるいは肌着の外側に両面テープで貼付する等して、皮膚に直接接触させることなく胸部等に固定して使用される。

【0014】

【発明の効果】 本発明製剤は「(1) 表面がさらっとして

おり、非常に取り扱い易く、また気化性薬物を使用し、通常の外用剤に用いられる基剤等を使用する必要がないので、衣類等を汚すことがない。(2) 使用時に直接皮膚に接触させる必要がないため、皮膚障害がなく安全である。(3) 多孔性繊維よりなる片状支持体に含有させた気化性薬物は、徐々に揮散され、効果が長時間持続する。(4) 製造方法が非常に簡単である。(5) 不必要なときには、すぐに取り去ることができ、薬効のコントロールが容易である。」等の優れた特性を有している。

【0015】以下に、本発明製剤の特性（気化性薬物の揮散性）試験およびモニター試験の結果を示す。

【0016】試験例1

本発明製剤における気化性薬物の揮散性：

(1) 試料

実施例3、実施例4および実施例5に従って得られた本発明製剤（気化性薬物として何れもd l-カンフル、l-メントール、ユーカリ油およびニクス油を含有）

(2) 試験方法

試料（n=4）をシャーレ上に置き、蓋をせずに37℃のエアーバス（Air Bath Unit A、大洋科学工業社製）中に保存して試料から気化性薬物を揮散させ、経時的に、*

* 試料中の気化性薬物の重量変化（気化性薬物残存量）を測定した。また、d l-カンフルおよびl-メントールについては、それぞれの含量変化（残存量）についても同時に測定した。

【0017】d l-カンフルおよびl-メントールの定量は、各時間経過後の試料（n=4）からそれらをメタノールで抽出し、サリチル酸メチル（Lot KPG5630、和光純薬社製）を内部標準に用いてガスクロマトグラフ法により行った。

(3) 結果

各試料の重量変化〔気化性薬物残存量（揮散減量）〕並びにd l-カンフルおよびl-メントールの含量変化（残存量）を百分率に換算してそれぞれ第1表から第3表に示した。

【0018】第1表から第3表に示されるように、本発明製剤に吸着、保持された気化性薬物は、本発明製剤から徐々に揮散され、その効果が長時間持続する。

【0019】

【表1】

第1表

経過時間 (h)	試料中の気化性薬物残存量 (%)		
	実施例3	実施例4	実施例5
0	100	100	100
0.5	84.3	77.6	70.6
1	73.8	62.4	58.7
2	68.3	39.7	42.1
4	37.3	23.4	18.4
6	27.9	9.1	14.9
8	11.7	6.8	0.7

※

第2表

【0020】

【表2】

※

経過時間 (h)	試料中のd l-カンフル残存量 (%)		
	実施例3	実施例4	実施例5
0	100	100	100
0.5	88.7	84.7	76.2
1	79.3	67.6	62.5
2	76.0	34.3	35.1
4	31.0	11.8	5.0
6	18.5	1.1	1.5
8	3.7	0.2	0.0

【0021】

【表3】

第3表

経過時間 (h)	試料中の1-メントール残存率 (%)		
	実施例3	実施例4	実施例5
0	100	100	100
0.5	97.4	98.5	95.1
1	95.3	90.9	93.2
2	96.1	78.3	83.8
4	75.2	56.3	51.3
6	63.0	25.8	44.4
8	35.8	19.6	2.5

【0022】試験例2

本発明製剤の有効性及び安全性（モニター試験）：

(1) 試料

実施例1で得られた本発明製剤および比較製剤【市販貼付剤、商品名「ハルトかぜバップ」（山之内製薬社製）】

(2) 試験方法

上記試料の有効性及び安全性について以下のようにして比較検討した。

【0023】すなわち、感冒の症状を訴える成人男女11名を、6名と5名の2群に分け、クロスオーバー法により上記試料のモニター試験を行った。6名の群は1日目の就寝時に本発明製剤を、2日目の就寝時に比較製剤を使用し、また、5名の群は1日目に比較製剤を、2日*

*目に本発明製剤を使用した。上記試料の有効性は、「息苦しさ」、「鼻づまり」、「鼻汁」、「くしゃみ」、「咳」、「痰の切れ」、「喉・胸・筋肉の痛み」の自覚症状について使用前～使用後の試料による各項目の改善度をそれぞれ所定のスコアで表わし、その結果をもとに各自総合的に判断して評価した。

【0024】上記試料の安全性は、「かぶれ」、「かゆみ」、「発赤」等の副作用の有無から各自評価した。

(3) 結果

結果を第4表に示した。第4表から明らかなように、本発明製剤は比較製剤と較べて有効性及び安全性の何れにおいても優れていた。

【0025】

【表4】

第4表

有効性（自覚症状改善度）に関して：

本発明製剤が比較製剤より優れる 6名
比較製剤が本発明製剤より優れる 1名
どちらとも言えない 4名

安全性に関して：

本発明製剤が比較製剤より優れる 5名
比較製剤が本発明製剤より優れる 0名
どちらとも言えない 6名

【0026】

【実施例】以下、実施例を挙げて本発明を更に具体的に説明する。

【0027】実施例1

アクワロン[®]スムース（品番；9160、鐘紡社製）を1片49cm²（7cm×7cm）に裁断して支持体とし、その1片宛て、d1-カンフル（Lot TAK-668、日本精化社製）0.14g および1-メントール（Lot 2342、小林桂社製）0.10g をユーカリ油（Lot 53891222、小川香料社製）0.07g およびニクズク油（Lot 01891221、小川香料社製）0.04g の混合物に溶解した溶液を支持体に滴下して均一に吸着、保持させ、感冒用吸入型製剤を得る。

【0028】実施例2

アクワロン[®]スムース（品番；9160、鐘紡社製）を1片100cm²（10cm×10cm）に裁断して支持体とし、その1片宛て、d1-カンフル（Lot TAK-668、日本精化社製）1.5gおよび1-メントール（Lot 2342、小林桂社製）1.0gをユーカリ油（Lot 53891222、小川香料社製）0.7gおよびニクズク油（Lot 01891221、小川香料社製）0.4gの混合物に溶解した溶液を支持体に滴下して均一に吸着、保持させ、感冒用吸入型製剤を得る。

【0029】実施例3

アクワロン[®]スムース（品番；9160、鐘紡社製）を1片25cm²（5cm×5cm）に裁断して支持体とし、その1片宛て、d1-カンフル（Lot TAK-668、日本精化社製）0.250gおよび1-メントール（Lot 2342、小林桂社

7

製) 0.175gをユーカリ油 (Lot: 53891222、小川香料社製) 0.125gおよびニクズク油 (Lot: 01891221、小川香料社製) 0.075gの混合物に溶解した溶液を支持体に滴下して均一に吸着、保持させ、感冒用吸入型製剤を得る。

【0030】実施例4

アクワロン[®]スムーズに替えてアクワロン[®]パイル (品

8

番; TN115、鐘紡社製) を使用する以外は実施例3と同様にして感冒用吸入型製剤を得る。

【0031】実施例5

アクワロン[®]スムーズに替えてアクワロン[®]ピエラP.T. (品番; 9074、鐘紡社製) を使用する以外は実施例3と同様にして感冒用吸入型製剤を得る。



2

DIALOG(R) File 351:Derwent WPI
(c) 2002 Thomson Derwent. All rts. reserv.

009470809

WPI Acc No: 1993-164348/199320

XRAM Acc No: C93-073011

Inhalant prepn. for common cold - comprises porous support of polyacrylic fibres contg. volatile agent e.g. camphor

Patent Assignee: KANEBO LTD (KANE)

Number of Countries: 001 Number of Patents: 001

Patent Family:

Patent No	Kind	Date	Applicat No	Kind	Date	Week
JP 5097663	A	19930420	JP 91292316	A	19911012	199320 B

Priority Applications (No Type Date): JP 91292316 A 19911012

Patent Details:

Patent No	Kind	Lan	Pg	Main IPC	Filing Notes
JP 5097663	A		5	A61K-009/72	

Abstract (Basic): JP 5097663 A

The inhalant preparation comprises a plate-like support of porous fibres contg. a volatile agent.

Pref. fibre is acrylic, and pref. agent is volatile pharmaceutical agent such as camphor, menthol, thymol, mentha oil, etc.

USE/ADVANTAGE - Useful as an emollient of cold symptons. It is comfortable to use and easily removed, compared to conventional prepn. for external use which are often sticky, cause dermatitis, and stain clothes. It also shows prolonged effect; a test showed 35-83% residue in two hours when maintained in an air bath at 37 deg. C.

In an example, an acrylic fibre was cut into a 7cm x 7cm size fragment, and dropped with a mace oil soln. of dl-camphor and l-menthol for uniform absorption to form an inhalant preparation for col an

Dwg.0/0

Title Terms: INHALE; PREPARATION; COMMON; COLD; COMPRISE; POROUS; SUPPORT; POLYACRYLIC; FIBRE; CONTAIN; VOLATILE; AGENT; CAMPHOR

Index Terms/Additional Words: INHALE; PREPARATION; COMMON

Derwent Class: B07

International Patent Class (Main): A61K-009/72

File Segment: CPI

THIS PAGE BLANK (USPTO)